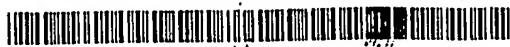


BEST AVAILABLE COPY

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2005年6月16日(6.06.2005)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 2005/054213 A1

(51)国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 261/08, 261/20, 261/18, 413/04, 417/12, A61K 31/42, 31/5377, 31/423, 31/5395, 31/4245, 31/5377, 31/502, 31/536, 31/435, 31/428, 31/427, 31/4427, 31/501, 31/506, A61P 43/00, 3/06, 3/10, 3/04, 9/10, 9/12, 29/00, 37/08, 1/04, 19/02, 1/18, 17/06, 17/04, 19/10, 15/00, 35/00, 25/28, 25/16

(21)国際出願番号: PCT/JP2004/017706

(22)国際出願日: 2004年11月29日(29.11.2004)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
 特願2003-403274 2003年12月2日(02.12.2003) JP  
 特願2004-121635 2004年4月16日(16.04.2004) JP  
 特願2004-167941 2004年6月7日(07.06.2004) JP  
 特願2004-316251 2004年10月29日(29.10.2004) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 Osaka (JP).

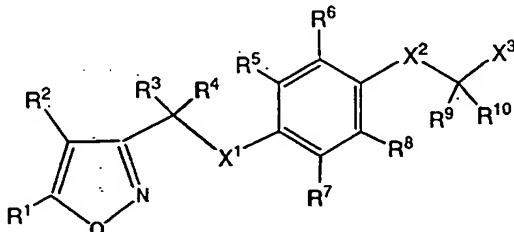
(72)発明者; および  
 (75)発明者/出願人(米国についてのみ): 福井 喜一 (FUKUI, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 笹谷 隆司 (SASATANI, Takashi) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 松村 謙一 (MATSUMURA, Ken-ichi) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 石塚 夏樹 (ISHIZUKA, Natsuki) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 矢野 利定 (YANO, Toshisada) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 神田 泰彦 (KANDA, Yasuhiko) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 長命 信雄 (CHOMEI, Nobuo) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74)代理人: 山内秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.); 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(締葉有)

(54) Title: ISOXAZOLE DERIVATIVE HAVING AGONISTIC ACTIVITY AGAINST PEROXISOME PROLIFERATOR-ACTIVATED RECEPTOR

(54)発明の名称: ペルオキシソーム増殖活性化受容体アゴニスト活性を有するイソキサゾール誘導体



(I)

provided that R<sup>14</sup> may be bonded to R<sup>6</sup> to form a ring in cooperation with the adjacent atoms, or -CR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>- (wherein R<sup>15</sup> and R<sup>16</sup> each independently is hydrogen or lower alkyl, provided that R<sup>15</sup> may be bonded to R<sup>6</sup> or R<sup>10</sup> to form a ring in cooperation with the adjacent carbon atoms and R<sup>16</sup> and R<sup>9</sup> in combination may form a bond); and X<sup>3</sup> is COOR<sup>17</sup>, C(NR<sup>17</sup>)NR<sup>18</sup>OR<sup>19</sup>, etc., pharmaceutically acceptable salts of the compounds, or solvates of any of these.

(57)要約: 式(I): 【化1】(式中、R<sup>1</sup>~R<sup>10</sup>は各々独立して水素、ハロゲン、置換基を有していてよい低級アルキル等であり、X<sup>1</sup>は-O-、-S-、-NR<sup>11</sup>- (ここでR<sup>11</sup>は水素または低級アルキル等)、-CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>CO-、-(CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>m</sub>O-または-O(CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>m</sub>- (ここでR<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は各々独立して水素または低級アルキルであり、mは1~3の整数)等であり、X<sup>2</sup>は単結合、-O-、-S-、-NR<sup>14</sup>- (ここでR<sup>14</sup>は水素または低級アルキル等、R<sup>14</sup>はR<sup>6</sup>と共に隣接する原子と一緒にになって環を形成してもよい)または-CR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>- (ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>は各々独立して水素または低級アルキルであり、R<sup>15</sup>はR<sup>6</sup>またはR<sup>10</sup>と共に隣接する炭素原子と一緒にになって環を形成してもよく、R<sup>16</sup>はR<sup>9</sup>と一緒にになって結合を形成してもよい)であり、X<sup>3</sup>はCOOR<sup>17</sup>またはC(=NR<sup>17</sup>)NR<sup>18</sup>OR<sup>19</sup>等である)で示される化合物、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

WO 2005/054213 A1